

WO9961029A1: SLEEP INDUCING AGENT

[View Images \(24 pages\)](#) | [View Cart](#)

Premium Data 1: [PDF \(228 KB\)](#) | [TIFF \(5160 KB\)](#) | [Fax](#) | [More choices...](#)

Inventor(s): **TANAMI, Tohru**, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170. ndash, Japan
KAMEO, Kazuya, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170. ndash, Japan
YAMADA, Kenji, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170. ndash, Japan
OKUYAMA, Shigeru, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170. ndash, Japan
ONO, Naoya, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170. ndash, Japan

Applicant(s): **SATO, Fumie**, 2-1-901, Kugenumahigashi, Fujisawa-shi, Kanagawa 251-0026, Japan

Issued/Filed Dates: **Dec. 2, 1999** / May 25, 1999

Application Number: **WO1999JP0002723**

IPC Class: **A61K 031/557; C07C 405/00;**

Designated Countries: AU, CA, CN, JP, KR, US. **European patent:** AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE

Abstract: A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by (CH₂)_m, a cis-vinylene group or a phenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, OCH₂ or S(O)nCH₂, R₁ is a C₃-10 cycloalkyl group, a C₃-10 cycloalkyl group substituted with a C₁-4 alkyl group, a C₄-13 cycloalkylalkyl group, a C₅-10 alkyl group, a C₅-10 alkenyl group, an C₅-10 alkynyl group or a bridged cyclic hydrocarbon group, R₂ represents a hydrogen atom, a C₁-10 alkyl group or a C₃-10 cycloalkyl, m is an integer of 1 to 3, and n is 0, 1 or 2, or a pharmaceutically acceptable salt or hydrate thereof.

[\[Show "fr" Abstract\]](#)

For representative images:

[View Images](#)



[\[Show "fr" image\]](#)

Attorney, Agent, or Firm:

KITAGAWA, Tomizo:

Foreign References:

none

(No patents reference this one)



Alternate Searches



[Patent Number](#)



[Boolean Text](#)



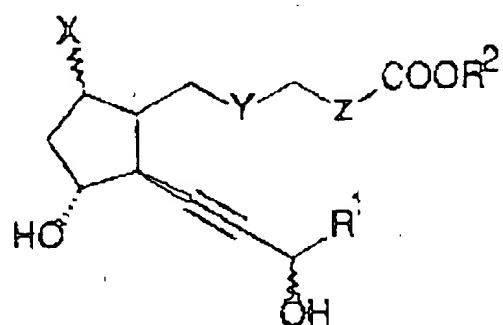
[Advanced Text](#)

Nominate this invention

Patent & Trademark Search & Patent Full Text

(57)要約

式



(式中、Xはハロゲン原子を示し、Yは $(\text{C}_2\text{H}_5)_n$ で表
シスビニレン基又はフェニレン基を示し、Zはエチレン
スピニレン基、 $\text{O}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ 又は $\text{S}(\text{O})_2\text{C}_2\text{H}_5$ を示し、R'は
シクロアルキル基、 C_{1-14} のアルキル基で置換された C_{1-14}
アルキル基、 C_{1-14} のシクロアルキルアルキル基、 C_{1-14}
アル基、 C_{1-14} のアルケニル基、 C_{1-14} のアルキニル基又
炭化水素基を示し、R^2は水素原子、 C_{1-14} のアルキル基
のシクロアルキル基を示し、mは1～3の整数を示し、
nは2を示す。)

て表されるテロスタグラシン誘導体又はその薬理学的
の薬および抗和物を有効成分とする睡眠誘発剤。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使

AB	アラブ首長国連邦
AF	アルゼンチン
AM	アルメニア
AT	オーストリア
AU	オーストラリア

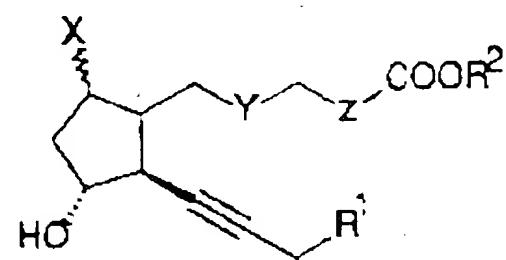
DE	ドイツ
ES	エストニア
FR	フランス
GB	イギリス

CA	カナダ
CL	チリ
DK	リヒテンシャウタイン
ES	スリランカ
FR	スリニア

BR	BR
SI	SI
SE	SE

(57) 要約

式



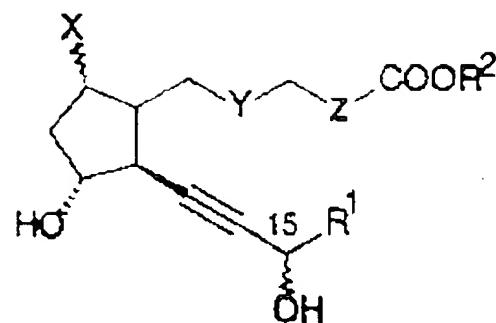
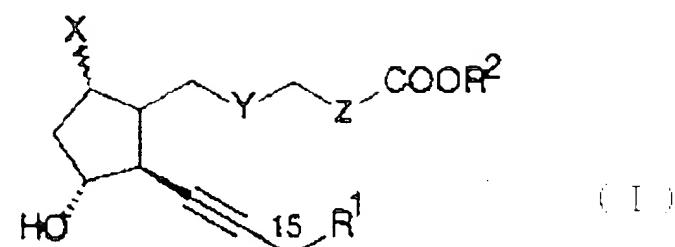


表 1

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 1	Br-CO	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	tert-丁基
化合物 2	Br-CO	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	丙基
化合物 3	Br-CO	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	甲基
化合物 4	Br-CO	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 5	Br-CO	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 6	Br-CO	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 7	Br-Br	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 8	Br-Br	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 9	Br	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 10	Br-Br	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 11	Br-Br	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 12	Br-Br	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 13	Br-Br	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 14	Br-CO	CH=CH	SC ₂ H ₅	溴代丙酸	tert-丁基
化合物 15	Br-CO	CH=CH	SC ₂ H ₅	溴代丙酸	水素
化合物 16	Br-CO	CH=CH	OC ₂ H ₅	溴代丙酸	tert-丁基



(I)



世界知的所有権機関
国際特許局

PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6 A61K 31/557, C07C 405/00	A1	(11) 国際公開番号 (43) 国際公開日 1999-05-25 (25.05.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP99/02723		(72) 発明者：およひ (75) 発明者／肖像人（米国にゆかりの 田名見亨(TANAMI, Tetsuro)[JP/JP] 龟尾一郎(KAMEO, Kazuya)[JP/JP] 山田憲司(YAMADA, Kenji)[JP/JP] 奥山 俊(OKUYAMA, Shigeru)[JP/JP] 小野直哉(ONO, Naoya)[JP/JP] 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目243 大正製薬株式会社内 Tokyo, (JP)
(22) 国際出願日 1998年5月25日(25.05.98)		(74) 代理人 弁理士 北川高造(KITAGAWA, Tomio) 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目243 大正製薬株式会社(特許部) Tokyo, (JP)
(30) 優先権データ 特願平10/142622 1998年5月25日(25.05.98)	JP	(71) 出願人（米国分野）の他の指定国について 大正製薬株式会社 KAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.[JP/JP] 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目243番1号 Tokyo, (JP)
(71) 出願人（日本分野） およひ (72) 発明者 佐藤克義(SATO, Fumio)[JP/JP] 〒251-0026 神奈川県藤沢市羽根沼東2-1-991 Kanagawa, (JP)		(81) 指定国 AU, CA, CN, JP, KR, US, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE,

添付公開書類
國際調査報告書

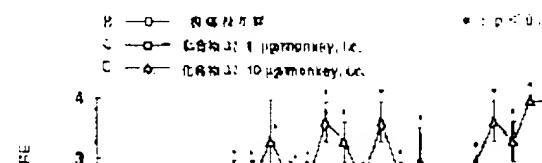
(54) Title: SLEEP INDUCING AGENT

(54) 発明の名前：睡眠誘導剤

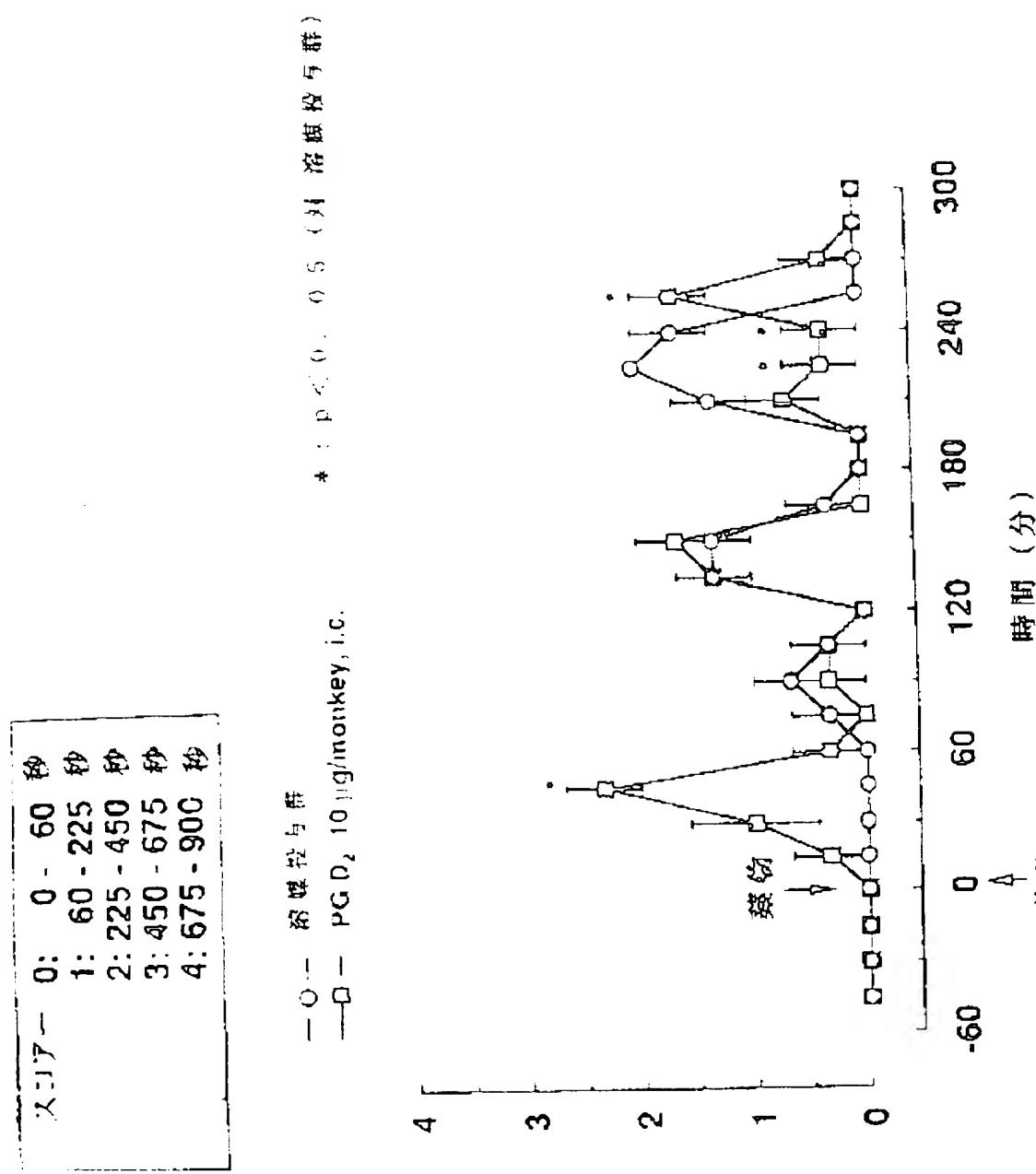
(57) Abstract

A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by $(\text{CH}_2)_m$, a cis-vinylene group or a pitenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, CCH_2 or SiO_2CH_2 , R₁ is a C_{10-20} cycloalkyl group, a C_{10-20} cycloalkyl group substituted with a C_{1-6} alkyl group, a C_{10-20} cycloalkylalkyl group, a C_{1-6} alkyl group, a C_{1-6}

スコア:	0: 0 - 50	50 - 100
SCORE	1: 50 - 225	225 - 450
	2: 225 - 450	450 - 675
	3: 450 - 675	675 - 800
	4: 675 - 800	800 - 1000



2 / 2



1 / 2

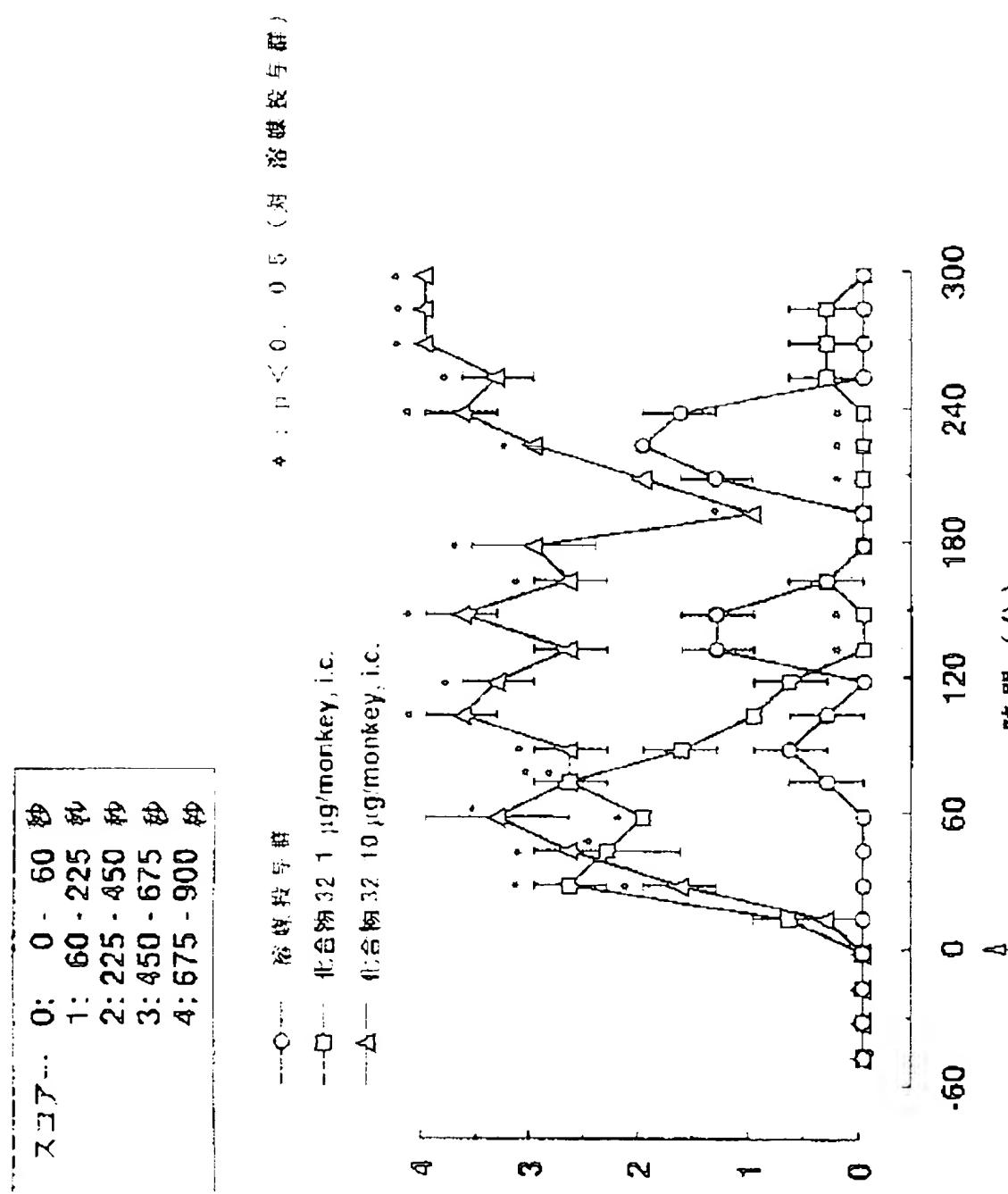


表 1 基本構造

	Z	X	Y	R ¹	R ²
化合物 71	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 72	CH=CH	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 73	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 74	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 75	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 76	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 77	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 78	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 79	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 80	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-アセチル	水素
化合物 81	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-(4-アセチル-1-オキソ)イソブチル	水素
化合物 82	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-(3-アセチル-1-オキソ)イソブチル	水素
化合物 83	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2, 6-(2-アセチル-5-ヘキソニル)イソブチル	水素
化合物 84	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-(6-アセチル-5-ヘキソニル)イソブチル	水素
化合物 85	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	1-(3-アセチル-5-ヘキソニル)イソブチル	水素
化合物 86	CH=CH	CH ₂ CH ₂	CH=CH	1-(4-アセチル-3-ヘキソニル)イソブチル	水素

本発明に係る化合物は、経口的に、または静脈内もしくは鼻などより経口的に投与することができる。これらは、例常の方法により製造することができる錠剤、粉剤、顆粒剤、カプセル剤、液剤、乳剤、懸濁剤等の形で経口投与されるこ

表 1 例の構造

	Z	X	Z	R^1	R^2
化合物 71	β -CH ₂	CH ₂ CH ₂	CH=CH	アセト酸	水素
化合物 72	β -CH ₂	CH ₂ CH ₂ CR ₂	CH=CH	アセト酸	水素

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R'	R''
化合物45	β -C1	CH ₂ CH ₃	SCH ₃	2,6-ジ(アリル-5-ヘテル)フェノル	水素
化合物46	β -C1- α -ヘキサメチル	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン		水素
化合物47	β -C1- α -ヘキサメチル	OC ₂ H ₅	シクロヘキサン		水素
化合物48	β -C1- α -ヘキサメチル	OC ₂ H ₅	シクロヘキサン		水素
化合物49	β -C1- α -ヘキサメチル	SCH ₃	シクロヘキサン		水素
化合物50	β -C1- α -ヘキサメチル	OC ₂ H ₅	シクロヘキサン		水素
化合物51	β -C1- α -ヘキサメチル	SCH ₃	シクロヘキサン		水素
化合物52	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	好
化合物53	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	水素
化合物54	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	水素
化合物55	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	水素
化合物56	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	水素
化合物57	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	好
化合物58	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	水素
化合物59	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	好
化合物60	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	水素
化合物61	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-(アリル-1-ヘテル)	好
化合物62	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-(アリル-1-ヘテル)	水素
化合物63	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2,6-ジ(アリル-5-ヘテル)フェノル	好
化合物64	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2,6-ジ(アリル-5-ヘテル)フェノル	水素
化合物65	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	1-(アリル-3-ヘテル)フェノル	好
化合物66	β -C1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	1-(アリル-3-ヘテル)フェノル	水素

WO 99/61029

PC

17

卷之三

表1のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物19	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物20	$\beta-\text{Cl}$	$(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物21	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物22	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物23	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物24	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物25	$\alpha-\text{Cl}$	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物26	$\beta-\text{Br}$	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物27	$\alpha-\text{Br}$	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物28	F	CH_2CH_2	OCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物29	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	tert-ブチル
化合物30	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	糊
化合物31	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	糊
化合物32	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物33	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物34	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物35	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物36	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物37	$\beta-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物38	$\alpha-\text{Cl}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物39	$\beta-\text{Br}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素
化合物40	$\alpha-\text{Br}$	CH_2CH_2	SCH_2	2-ブロモキノリ	水素

表1のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物19	CH ₂ CO	CH ₂ CH ₂	CH ₂	2-メチル-1-プロパン	水素
化合物20	CH ₂ CO	(CH ₂ CH ₂) ₂	CH ₂	2-メチル-1-プロパン	水素